

一步制粒法(marumerization)成球的动力学

张国华^{1,2} Schwartz JB¹ Schnaare RL¹ Sugita ET¹ Wigent RJ¹

(¹ 费城药理学学院, 美国宾夕法尼亚州; ² 药剂学教研室)

采用“混合材料-挤压成粒-滚转成球”的一步法制粒机(marumerizer)制备了扑热息痛微球, 观察到软材在机中停留时间越长, 大球粒子(直径大于 14 μ m)形成的比例越高。根据两细粒碰撞聚集成球的假说, 认为可按二级速度方程式, 推算出剩余细粒的倒数 $1/(s-x)$ 与机中停留时间(t)呈线性关系, 实验证实了这种关系($r=0.999$)。实验还证明了滚转时间越长, 球粒中药物的释放速度越慢。溶出速率试验表明, 这种球粒中药物的释放符合 Higuch 的平方根函数关系。

关键词 一步制粒法; 微球生长; 扑热息痛

【文摘 010】 2-萘-3-(3, 4-二甲氧基) 苯-丙烯酸对兔血小板花生四烯酸代谢的影响 孙晓明, 徐融本, 吴余升, 林成仁, 郭昌燕. 中国药理学报 1990; 11(1): 51-4

苯丙烯酸类化合物对花生四烯酸-前列腺素代谢有影响, 作者用体外放射化学方法对 2-萘-3-(3, 4-二甲氧基) 苯-丙烯酸 (NMPA) 对血小板花生四烯酸代谢的影响进行了研究。结果表明 NMPA 在终浓度 0.05~0.5 mmol/L 范围内可使兔血小板环加氧酶-血栓素合成酶系终产物 TXB₂ 的生成率由 23.8% 降至 3.17%, 效应与剂量相关。推测 NMPA 对该酶系有抑制作用, 从而使代谢途径改进, 通过此种作用而抑制血小板的活化。

【文摘 011】 用在体脑微透析技术研究大鼠纹状体中单胺递质的释放和代谢 吴惠秋, 金晓南, 谢林, 金辉, 葛琪, 刘国卿. 中国药理学与毒理学杂志 1990; 4(1): 9-13

采用脑微透析技术与高效液相色谱-电化学检测器联用测定了清醒自由活动大鼠纹状体细胞外液中多巴胺 (DA) 及其酸性代谢物 3, 4-二羟苯乙酸

(DOPAC) 和高香草酸 (HVA) 以及 5-羟色胺代谢物 5-羟吲哚乙酸 (5-HIAA) 的含量。透析液中 DA 为 0.44 pmol/40 μ l, DOPAC 和 HVA 含量较 DA 高约 80 倍。右旋苯丙胺 2 mg/kg, ip 使纹状体 DA 释放显著增加, DOPAC 和 HVA 含量明显下降。

【文摘 012】 脂蟾毒甙对家兔血液动力学的影响

朱远, 后德辉. 中国药理学与毒理学杂志 1990; 4(1): 14-6

为探讨脂蟾毒 (RBG) 的升压作用与心输出量、外周阻力之间的内联系, 作者观察并分析了 RBG 对正常及失血性休克家兔血液动力学的影响。iv RBG 0.3 mg/kg 能明显升高麻醉开胸及失血性休克家兔的动脉血压。血液动力学研究表明: RBG 能明显增加麻醉开胸家兔的 $+dP/dt_{max}$, LVP 和 TPRI, 基于 TPRI 增加的同时 CI 并不增加的现象推测其升压作用主要与其增加外周阻力有关; RBG 对失血性休克家兔血液动力学的影响基本同上, 唯 CI 比休克时显著增加, 故认为 RBG 对失血性休克兔的升压作用可能是其正性肌力, 增加心输出量和增加外周阻力协同作用的结果。